

ИНСТРУКЦИЯ

(информация для специалиста)

по медицинскому применению лекарственного средства

ЭУФИЛЛИН

Торговое название: Эуфиллин

Международное непатентованное название: Aminophylline.

Форма выпуска: таблетки 150 мг.

Состав: 1 таблетка содержит: *действующего вещества:* аминофиллина – 150 мг; *вспомогательные вещества:* повидон, магния стеарат, крахмал картофельный.

Описание: таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрические, с фаской.

Фармакотерапевтическая группа: прочие средства системного применения для лечения обструктивных заболеваний дыхательных путей. Ксантины.

Код АТХ: R03DA05.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Бронхолитическое средство, производное ксантина; ингибирует фосфодиэстеразу, увеличивает накопление в тканях аденозинмонофосфата (цАМФ), блокирует аденозиновые (пуриновые) рецепторы; снижает поступление ионов кальция через каналы клеточных мембран, уменьшает сократительную активность гладкой мускулатуры.

Расслабляет мускулатуру бронхов, стимулирует дыхательный центр, повышает его чувствительность к углекислому газу и улучшает альвеолярную вентиляцию, что в конечном итоге приводит к снижению тяжести и частоты эпизодов апноэ. Нормализуя дыхательную функцию, способствует насыщению

крови кислородом и снижению концентрации углекислоты.

Оказывает стимулирующее влияние на деятельность сердца, увеличивает силу и число сердечных сокращений, повышает коронарный кровоток и повышает потребность миокарда в кислороде.

Снижает тонус кровеносных сосудов, главным образом, сосудов мозга, кожи и почек. Оказывает периферическое венодилатирующее действие, уменьшает легочное сосудистое сопротивление, понижает давление в малом круге кровообращения. Увеличивает почечный кровоток, оказывает умеренный диуретический эффект. Расширяет внепеченочные желчные пути. Стабилизирует мембраны тучных клеток, тормозит высвобождение медиаторов аллергических реакций.

Тормозит агрегацию тромбоцитов (подавляет фактор активации тромбоцитов и простагландин E2 (PGE₂)), повышает устойчивость эритроцитов к деформации (улучшает реологические свойства крови), уменьшает тромбообразование и нормализует микроциркуляцию.

Обладает токолитическим действием, повышает кислотность желудочного сока. При использовании в больших дозах обладает эпилептогенным действием.

Фармакокинетика

При приеме внутрь всасывается быстро и достаточно полно. Биодоступность аминофиллина составляет 80-100 %. Алкоголь увеличивает скорость и полноту абсорбции. Бронхорасширяющее действие проявляется при поддержании его концентрации в плазме крови на уровне 10-20 мкг/мл, стимулирующее влияние на дыхательный центр реализуется при более низких концентрациях - 5-10 мкг/мл. Концентрация аминофиллина в плазме свыше 20 мкг/мл является токсической.

После внутривенного введения на 60 % находится в связанном с белками крови состоянии (при циррозе печени доля связанной с белком фракции понижается до 35 %, а у новорожденных детей данный показатель составляет 36 %). Хорошо проникает через гистогематические барьеры и равномерно распределяется в крови, внеклеточной жидкости и мышечной ткани. В жировой ткани не

накапливается. Проникает через плацентарный барьер и в молоко матери. Объем распределения составляет 0,3-0,7 л/кг (в среднем 0,45 л/кг).

Подвергается интенсивному метаболизму в печени (около 90 %), под влиянием метилаз и цитохрома Р450 частично переходит в кофеин. У детей до 3 лет вследствие высокой метилазной активности гепатоцитов и медленной элиминации кофеина его концентрация может достигать 30 % от концентрации аминофиллина. У взрослых и детей старше 3-х лет феномена кумуляции кофеина не наблюдается.

Выделяется почками, причем 10 % у взрослых и около 50 % у детей – в неизменном виде. Период полуэлиминации эуфиллина ($T_{1/2}$) зависит от возраста и сопутствующих заболеваний. У новорожденных и детей до 6 мес он составляет >24 ч; у детей старше 6 мес – 3,7 ч; у взрослых, не страдающих бронхолегочной патологией – 8,7 ч. У лиц, выкуривающих 20-40 сигарет в сутки, $T_{1/2}$ укорачивается до 4-5 ч, причем после отказа от курения восстановление скорости элиминации аминофиллина происходит только через 3-4 мес. У лиц с обструктивными заболеваниями легких, сердечной недостаточностью и легочным сердцем период полуэлиминации удлиняется до 24 ч. Прием алкоголя и кофеинсодержащих напитков замедляет элиминацию аминофиллина и повышает его уровень в организме.

Показания к применению

- хронический обструктивный бронхит;
- бронхиальная астма (профилактика бронхоспазма, препарат выбора при астме физического напряжения, дополнительное средство при прочих формах астмы);
- эмфизема легких;
- ночное пароксизмальное апноэ (синдром Пиквика);
- хроническое легочное сердце.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к эуфиллину и другим производным метилксантина;
- инфаркт миокарда в острой фазе;

СОГЛАСОВАНО
МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
Приказ Министерства здравоохранения
Республики Беларусь

- тахикардия;
- гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия;
- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения;
- тяжелые нарушения функции печени и/или почек;
- гипертиреоз;
- эпилепсия;
- прием эфедрина (у детей);
- детский возраст до 6 лет;
- гастрит с повышенной кислотностью;
- тяжелая артериальная гипер- и гипотензия;
- геморрагический инсульт;
- кровоизлияние в сетчатку глаза.

С осторожностью

Ишемическая болезнь сердца (стенокардия), распространенный атеросклероз сосудов, частая желудочковая экстрасистолия, повышенная судорожная готовность, печеночная и/или почечная недостаточность легкой и умеренной степени, язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки в анамнезе, желудочно-кишечное кровотечение в недавнем анамнезе, неконтролируемый гипотиреоз (возможность кумуляции), длительная гипертермия, гастроэзофагеальный рефлюкс, аденома предстательной железы, беременность, период лактации, пожилой возраст, детский возраст.

Способ применения и дозы

Применяют внутрь после еды, запивая большим количеством жидкости.

Дозу следует подбирать в соответствии с индивидуальными особенностями каждого больного, с учетом клинического ответа и стабильной концентрации эуфиллина в сыворотке крови. Расчет дозы проводят исходя из идеальной массы тела (т.к. препарат не распределяется в жировую ткань).

Внутрь, взрослым следует назначать по 150 мг 3-4 раза в день.

Детям старше 6 лет следует назначать из расчета 7-10 мг/кг в сутки в 4 приема.

Высшие дозы эуфиллина для взрослых: разовая - 500 мг, суточная - 1500 мг.

Высшие дозы для детей старше 6 лет: разовая - 7 мг/кг, суточная - 15 мг/кг.

Длительность курса лечения - от нескольких дней до нескольких месяцев, в зависимости от течения заболевания и переносимости препарата. Для уменьшения токсических эффектов эуфиллин следует назначать в минимальных эффективных дозах.

Побочное действие

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, бессонница, возбуждение, тревожность, раздражительность, тремор.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение, тахикардия (в том числе у плода при приеме беременной в III триместре), аритмии, кардиалгия, снижение артериального давления, увеличение частоты приступов стенокардии.

Со стороны пищеварительной системы: гастралгия, тошнота, рвота, гастроэзофагеальный рефлюкс, изжога, обострение язвенной болезни желудка и 12-перстной кишки, диарея, при длительном приеме - снижение аппетита.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, лихорадка.

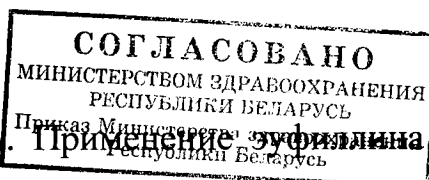
Прочие: боль в груди, тахипноэ, ощущение «приливов» к лицу, альбуминурия, гематурия, гипогликемия, усиление диуреза, повышенное потоотделение.

Побочные эффекты уменьшаются при снижении дозы препарата.

Меры предосторожности

Беременность и лактация. Применение эуфиллина при беременности может привести к созданию в организме новорожденного и плода потенциально опасных концентраций теофиллина и кофеина. Новорожденные, матери которых во время беременности (особенно III триместр) получали эуфиллин, нуждаются в медицинском наблюдении для контроля возможных симптомов интоксикации метилксантинами. Назначение препарата во время беременности и лактации требует оценки потенциального риска для ребенка и производится

только по экстремальным жизненным показаниям.



Использование в гериатрии и неонатологии. В форме таблеток у детей младше 6 лет не рекомендуется в связи с трудностями при введении препарата. У лиц старше 60 лет применение эуфиллина должно проводиться в низких дозах, в условиях мониторинга концентрации эуфиллина в плазме крови.

Эуфиллин не применяют одновременно с другими производными ксантина. В период лечения следует избегать употребления пищевых продуктов и напитков, содержащих производные ксантина (крепкий чай, кофе, шоколад, какао, мате).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управление механизмами. При приеме внутрь в терапевтических дозах эуфиллин не оказывает влияние на способность к занятию потенциально опасными видами деятельности.

Лекарственное средство может вызвать побочные реакции со стороны нервной системы (головокружение, возбуждение, тремор), пациентам необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и работе с движущимися механизмами.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Повышает вероятность развития побочных эффектов глюкокортикостероидов и минералокортикостероидов (гипернатриемия), средств для общей анестезии (возникает риск возникновения желудочковых аритмий), средств, возбуждающих центральную нервную систему (увеличивает нейротоксичность).

Противодиарейные препараты и энтеросорбенты снижают всасывание аминофиллина. Рифампицин, фенобарбитал, фенитоин, изониазид, карбамазепин, сульфипиразон, аминоглутетимид, пероральные эстрогенсодержащие контрацептивы и морицизин, являясь индукторами микросомального окисления, повышают клиренс аминофиллина, что может потребовать увеличения его дозы.

При одновременном применении с антибиотиками группы макролидов, линкомицином, аллопуринолом, циметидином, изопреналном, эноксацином,

небольшими дозами этанола, дисульфирамом, фторхинолонами, рекомбинантным интерфероном альфа, метотрексатом, мексилетином, пропафеноном, тиабендазолом, тиклопидином, верапамилом и при вакцинации против гриппа интенсивность действия аминифиллина может увеличиваться, что может потребовать снижения его дозы.

Увеличивает действие бета-адреностимуляторов и диуретиков (в том числе за счет увеличения клубочковой фильтрации; снижает эффективность препаратов лития и бета-адреноблокаторов. Совместим со спазмолитиками, не применяют совместно с другими производными ксантина. С осторожностью назначают одновременно с антикоагулянтами.

Передозировка

Симптомы: снижение аппетита, гастралгия, диарея, тошнота, рвота (в том числе с кровью), желудочно-кишечное кровотечение, тахипноз, гиперемия кожи лица, тахикардия, желудочковые аритмии, бессонница, двигательное возбуждение, тревожность, светобоязнь, тремор, судороги. При тяжелом отравлении могут развиваться эпилептические припадки (особенно у детей без возникновения каких-либо предвестников), гипоксия, метаболический ацидоз, гипергликемия, гипокалиемия, снижение артериального давления, некроз скелетных мышц, спутанность сознания, почечная недостаточность с миоглобинурией.

Лечение: отмена препарата, промывание желудка, назначение активированного угля, слабительных лекарственных средств, форсированный диурез, гемосорбция, плазмосорбция, гемодиализ (эффективность не высока, перитонеальный диализ не эффективен), симптоматическая терапия (в том числе метоклопрамид и ондансетрон - при рвоте). При возникновении судорог поддерживать проходимость дыхательных путей и проводить оксигенотерапию. Для купирования припадков введение внутривенно диазепама в дозе 0,1- 0,3 мг/кг (но не более 10 мг). При сильной тошноте и рвоте - метоклопрамид и ондансетрон (внутривенно).

Упаковка

10 таблеток в контурную ячейковую упаковку;

1 или 3 контурные ячейковые упаковки с листком-вкладышем помещают

в пачку из картона.

Условия хранения

В защищенном от света и влаги месте, при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не применять после окончания срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту врача.

Информация о производителе

Открытое акционерное общество «Борисовский завод медицинских препаратов», Республика Беларусь, Минская обл., г. Борисов, ул. Чапаева, 64, тел/факс +375(177)735612, 731156.

